

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2005年8月11日 (11.08.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/072066 A3

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 491/107, A61K 31/4166, A61P 27/02, 3/10, A01K 67/00, G01N 33/50, 33/15

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/001187

(22) 国際出願日: 2005年1月28日 (28.01.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2004-022547 2004年1月30日 (30.01.2004) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 株式会社  
三和化学研究所 (SANWA KAGAKU KENKYUSHO  
CO., LTD.) [JP/JP]; 〒4618631 愛知県名古屋市東区東  
外堀町35番地 Aichi (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 加藤 憲明 (KATO,

Noriaki) [JP/JP]; 〒4618631 愛知県名古屋市東区東外  
堀町35番地 株式会社三和化学研究所内 Aichi (JP).  
長野 弘 (NAGANO, Hiroshi) [JP/JP]; 〒4618631 愛知県  
名古屋市東区東外堀町35番地 株式会社三和化学研  
究所内 Aichi (JP). 谷古 香 (TANIKO, Kaori) [JP/JP]; 〒  
4618631 愛知県名古屋市東区東外堀町35番地 株式  
会社三和化学研究所内 Aichi (JP). 城森 孝仁 (JOMORI,  
Takahito) [JP/JP]; 〒4618631 愛知県名古屋市東区東外  
堀町35番地 株式会社三和化学研究所内 Aichi (JP).

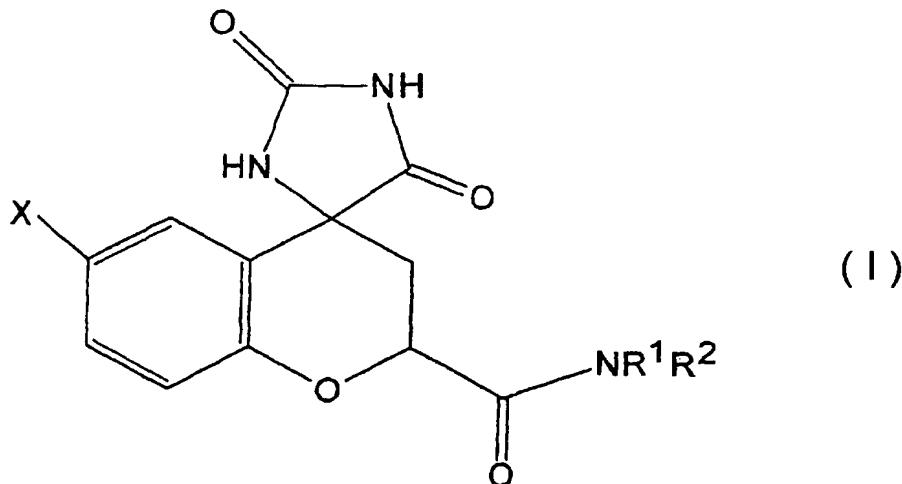
(74) 代理人: 小林 洋平 (KOBAYASHI, Youhei); 〒5110068  
三重県桑名市中央町4丁目44番地 ウインズビル  
2階ケーワイ国際特許事務所 Mic (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が  
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,  
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,

[統葉有]

(54) Title: PREVENTIVE OR THERAPEUTIC AGENT FOR DIABETIC MACULOPATHY

(54) 発明の名称: 糖尿病黄斑症の予防又は治療剤



WO 2005/072066 A3

(57) Abstract: [PROBLEMS] To provide a preventive or therapeutic agent for diabetic maculopathy that exhibits efficacy through a mechanism different from that of existing medicines and that can be taken for a prolonged period of time. [MEANS FOR SOLVING PROBLEMS] There is provided a preventive or therapeutic agent for diabetic maculopathy, comprising as an active ingredient a compound of the general formula: (wherein X is a halogen or hydrogen atom; and R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> simultaneously or separately represent a hydrogen atom and unsubstituted or substituted C<sub>1-6</sub> alkyls, or alternatively R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> together cooperate with a nitrogen atom, or further with another nitrogen atom or oxygen atom to represent a 5 to 6-membered heterocycle). As a particularly preferred compound, there can be mentioned (2S,4S)-6-fluoro-2',5'-dioxospiro[chroman-4,4'-imidazolidine]-2-carboxamide. Moreover, there is provided a model animal for diabetic maculopathy having edema developed in the neuroepithelial layer of retina or macula lutea by subjecting a diabetic animal to intraocular ischemia/re-perfusion treatment.

[統葉有]



NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ヨーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),

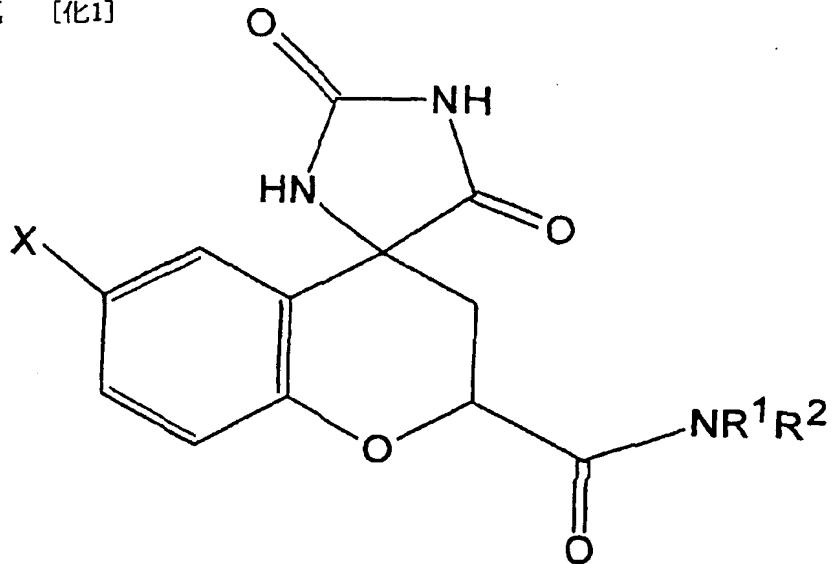
添付公開書類:  
— 國際調査報告書

(88) 國際調査報告書の公開日: 2005年10月6日

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドスノート」を参照。

(57) 要約:

本発明は、一般式 [化1]



(式中、Xはハロゲン又は水素原子を意味し、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は、同時に或いは別々に、水素原子、置換されていてもよいC1-6アルキル基を示すか、又は、R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>は一緒に窒素原子と共に或いは更に他の窒素原子又は酸素原子と共に5-6員の複素環を示す。)で示される化合物を有効成分とする、糖尿病黄斑症の予防又は治療剤である。中でも、化合物としては、(2S, 4S)-フルオロー-2', 5'-ジオキソスピロ[クロマン-4', 4'-イミダゾリジン]-2-カルボキサミドが好ましい。

本発明はまた、糖尿病動物に眼内虚血・再灌流処置を行い、網膜視細胞層又は黄斑部に浮腫を発現させた、糖尿病黄斑症のモデル動物、および係るモデル動物を利用した糖尿病黄斑症に対する薬物の評価方法を提供する。